

27. 9. 2004

日本国特許庁
JAPAN PATENT OFFICE

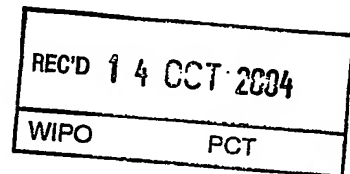
別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日
Date of Application: 2003年10月15日

出願番号
Application Number: 特願2003-354758
[ST. 10/C]: [JP2003-354758]

出願人
Applicant(s): 住友化学工業株式会社



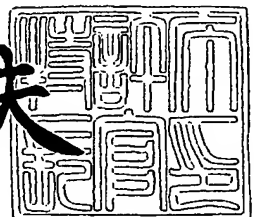
CERTIFIED COPY OF
PRIORITY DOCUMENT

PRIORITY
DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

2004年 6月17日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

今井康夫



Best Available Copy

【書類名】 特許願
【整理番号】 P156062
【提出日】 平成15年10月15日
【あて先】 特許庁長官殿
【国際特許分類】 A01N 43/836
A01N 43/34
A01N 43/84
C07N285/08
C07D207/00
C07D209/00

【発明者】
【住所又は居所】 兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号、住友化学工業株式会社内
【氏名】 井原 秀樹

【発明者】
【住所又は居所】 兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号 住友化学工業株式会社内
【氏名】 水野 肇

【発明者】
【住所又は居所】 兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号 住友化学工業株式会社内
【氏名】 高岡 大介

【特許出願人】
【識別番号】 000002093
【氏名又は名称】 住友化学工業株式会社

【代理人】
【識別番号】 100093285
【弁理士】
【氏名又は名称】 久保山 隆
【電話番号】 06-6220-3405

【選任した代理人】
【識別番号】 100113000
【弁理士】
【氏名又は名称】 中山 亨
【電話番号】 06-6220-3405

【選任した代理人】
【識別番号】 100119471
【弁理士】
【氏名又は名称】 榎本 雅之
【電話番号】 06-6220-3405

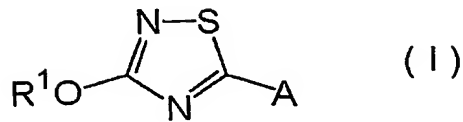
【手数料の表示】
【予納台帳番号】 010238
【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】
【物件名】 特許請求の範囲 1
【物件名】 明細書 1
【物件名】 要約書 1
【包括委任状番号】 0212949

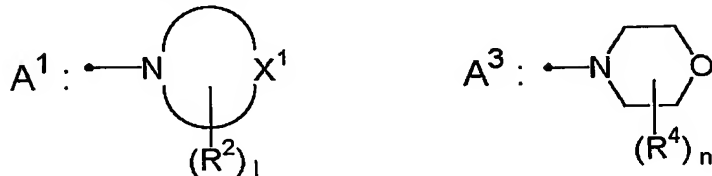
【書類名】 特許請求の範囲

【請求項 1】

式 (I)



〔式中、R¹はC 3－C 7アルキニル基を表し、
Aは下記のA¹又はA³を表し、



X¹はC 4－C 7アルカンジイル基又はC 4－C 7アルケンジイル基を表し、
R²はハロゲン原子、トリフルオロメチル基又はC 1－C 4アルキル基を表し、
R⁴はC 1－C 3アルキル基を表し、

lは0～4までの整数を表し、nは0～2の整数を表す。

lが2以上の整数である場合、R²は同一又は相異なる基を表し、

nが2である場合、R⁴は同一又は相異なる基を表す。〕

で示される1, 2, 4-チアジアゾール化合物。

【請求項 2】

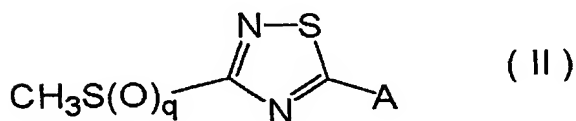
請求項1記載の1, 2, 4-チアジアゾール化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

【請求項 3】

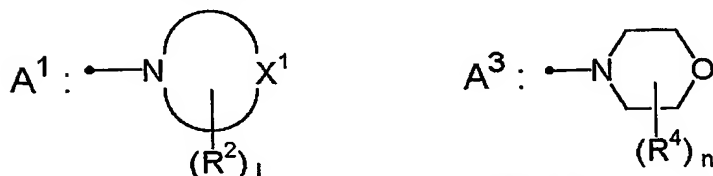
請求項1記載の1, 2, 4-チアジアゾール化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用することを特徴とする有害生物の防除方法。

【請求項 4】

式 (II)



〔式中、Aは下記のA¹又はA³を表し、



X¹はC 4－C 7アルカンジイル基又はC 4－C 7アルケンジイル基を表し、
R²はハロゲン原子、トリフルオロメチル基又はC 1－C 4アルキル基を表し、
R⁴はC 1－C 3アルキル基を表し、

lは0～4までの整数を表し、nは0～2の整数を表す。

lが2以上の整数である場合、R²は同一又は相異なる基を表し、

nが2である場合、R⁴は同一又は相異なる基を表し、

qは1又は2を表す。〕

で示される1, 2, 4-チアジアゾール化合物。

【書類名】明細書

【発明の名称】1, 2, 4-チアジアゾール化合物、その用途ならびに中間体

【技術分野】

【0001】

本発明は1, 2, 4-チアジアゾール化合物とその有害生物防除用途ならびにその中間体に関する。

【背景技術】

【0002】

従来より、有害生物に対して防除活性を有する化合物が有害生物防除剤の有効成分として見出され、開発されている（例えば、特許文献1参照。）。

【0003】

【特許文献1】特開2002-338557号公報。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

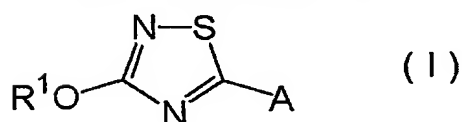
本発明は、有害生物に対して優れた防除活性を有する化合物と該化合物による有害生物の防除方法、ならびに該化合物の中間体を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

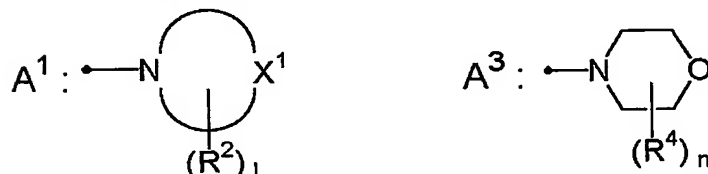
【0005】

本発明者等は、有害生物に対して優れた防除効力を有する化合物を見出すべく鋭意検討した結果、下記式(I)で示される1, 2, 4-チアジアゾール化合物が有害生物に対して優れた防除効力を有することを見出した。

即ち、本発明は式(I)



〔式中、R¹はC3-C7アルキニル基を表し、
Aは下記のA¹又はA³を表し、



X¹はC4-C7アルカンジイル基又はC4-C7アルケンジイル基を表し、
R²はハロゲン原子、トリフルオロメチル基又はC1-C4アルキル基を表し、
R⁴はC1-C3アルキル基を表し、

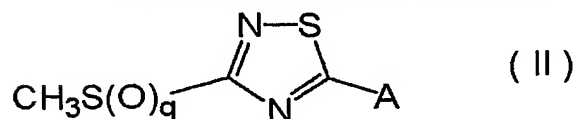
1は0~4までの整数を表し、nは0~2の整数を表す。

1が2以上の整数である場合、R²は同一又は相異なる基を表し、

nが2である場合、R⁴は同一又は相異なる基を表す。〕

で示される1, 2, 4-チアジアゾール化合物（以下、本発明化合物と記す。）、本発明化合物を有効成分とする有害生物防除剤及び本発明化合物の有効成分を有害生物又は有害生物の生息場所に施用することを特徴とする有害生物の防除方法を提供する。

また本発明は、本発明化合物の製造中間体として有用な式(II)



〔式中、Aは前記と同じ意味を表し、qは1又は2を表す。〕

で示される1, 2, 4-チアジアゾール化合物（以下、本発明中間体と記す。）も提供す

る。

【発明の効果】

【0006】

本発明化合物は優れた有害生物防除効力を有することから、有害生物防除剤の有効成分として有用である。また、本発明中間体は本発明化合物の製造において有用である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0007】

本発明において

R¹で示されるC3-C7アルキニル基としては、例えば2-プロピニル基、2-ブチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-ペンチニル基、4,4-ジメチル-2-ペンチニル基、1-メチル-2-プロピニル基及び1,1-ジメチル-2-プロピニル基が挙げられ、

X¹で示されるC4-C7アルカンジイル基としては、ブタン-1,4-ジイル基、ペンタン-1,5-ジイル基、ヘキサン-1,6-ジイル基、ヘプタン-1,7-ジイル基が挙げられ、

C4-C7アルケンジイル基としては、例えば2-ブテン-1,4-ジイル基、2-ペンテン-1,5-ジイル基、2-ヘキセン-1,6-ジイル基、3-ヘキセン-1,6-ジイル基等が挙げられ、

R²で示されるハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子及び臭素原子が挙げられ、C1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、sec-プロピル基及びtert-ブチル基が挙げられる。

R³及びR⁴で示されるC1-C3アルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基及びイソプロピル基が挙げられる。

Aで示される基としては前記のA¹及びA³が挙げられ、

A¹としては、例えばピロリジノ基、2-メチルピロリジノ基、2-エチルピロリジノ基、2-n-プロピルピロリジノ基、2-イソプロピルピロリジノ基、2-tert-ブチルピロリジノ基、2-フルオロピロリジノ基、2-トリフルオロメチルピロリジノ基、3-メチルピロリジノ基、3-エチルピロリジノ基、3-トリフルオロメチルピロリジノ基、2,5-ジメチルピロリジノ基、3,4-ジメチルピロリジノ基、3,3-ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2-メチルピペリジノ基、2-エチルピペリジノ基、2-n-プロピルピペリジノ基、2-イソプロピルピペリジノ基、2-tert-ブチルピペリジノ基、2-sec-ブチルピペリジノ基、2-フルオロピペリジノ基、2-プロモピペリジノ基、2-トリフルオロメチルピペリジノ基、3-メチルピペリジノ基、3-エチルピペリジノ基、3-n-プロピルピペリジノ基、3-イソプロピルピペリジノ基、3-tert-ブチルピペリジノ基、3-sec-ブチルピペリジノ基、3-フルオロピペリジノ基、3-プロモピペリジノ基、3-トリフルオロメチルピペリジノ基、4-メチルピペリジノ基、4-エチルピペリジノ基、4-n-プロピルピペリジノ基、4-イソプロピルピペリジノ基、4-tert-ブチルピペリジノ基、4-トリフルオロメチルピペリジノ基、2,6-ジメチルピペリジノ基、2,4-ジメチルピペリジノ基、2,5-ジメチルピペリジノ基、3,5-ジメチルピペリジノ基、2,2-ジメチルピペリジノ基、3,3-ジメチルピペリジノ基、4,4-ジメチルピペリジノ基、3-エチル-6-メチルピペリジノ基、3-エチル-5-メチルピペリジノ基、3,5-ジエチルピペリジノ基、3,5-ジ-n-プロピルピペリジノ基、3,5-ジイソプロピルピペリジノ基、2,3-ジメチルピペリジノ基、3,3,5-トリメチルピペリジノ基、2,3,5,6-テトラメチルピペリジノ基、3,3,5,5-テトラメチルピペリジノ基、3,3-ジフルオロピペリジノ基、4,4-ジフルオロピペリジノ基、3-フルオロ-3-メチルピペリジノ基、ヘキサメレンイミノ基、2-メチルヘキサメレンイミノ基、2-エチルヘキサメレンイミノ基、2-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、2-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、2-tert-ブチルヘキサメレンイミノ基、3-メチルヘキサメレンイミノ基、3-エチルヘキサメレンイミノ基、3-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、3-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、4

ーメチルヘキサメレンイミノ基、4-エチルヘキサメレンイミノ基、4-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、4-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、5-メチルヘキサメレンイミノ基、ヘプタメチレンイミノ基、3-ピロリノ基、3-メチル-3-ピロリノ基、3, 4-ジメチル-3-ピロリノ基、2, 5-ジメチル-3-ピロリノ基、1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジノ基、6-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジノ基、5-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジノ基、4-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジノ基、3-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジノ基、2-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジノ基、2, 6-ジメチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジノ基、1, 2, 3, 4, 7-ペンタヒドロアゼピノ基、1, 2, 3, 6, 7-ペンタヒドロアゼピノ基が挙げられ、
 A^3 としては、例えばモルホリノ基、2-メチルモルホリノ基、2-エチルモルホリノ基、3-メチルモルホリノ基、3-エチルモルホリノ基、2, 6-ジメチルモルホリノ基、2, 6-ジエチルモルホリノ基が挙げられる。

【0008】

本発明化合物の態様としては、例えば以下の1, 2, 4-チアジアゾール化合物が挙げられる。

式(I)において、 R^1 が(C3-C7)2-アルキニル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、 R^1 が2-ブチニル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、 R^1 が2-ペンチニル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^3 で示されるチアジアゾール化合物；

【0009】

式(I)において、Aが A^1 であり、1が0で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、1が1又は2で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 R^2 がC1-C4アルキル基であり、1が1又は2で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 R^2 がメチル基であり、1が1又は2で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 X^1 がブタン-1, 4-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 X^1 がペンタン-1, 5-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 X^1 がヘキサン-1, 6-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

【0010】

式(I)において、Aが A^1 であり、 R^2 がC1-C4アルキル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 R^2 がメチル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 X^1 がブタン-1, 4-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^1 であり、 X^1 がペンタン-1, 5-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

【0011】

式(I)において、Aが A^3 であり、nが0で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^3 であり、 R^4 がメチル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、Aが A^3 であり、nが1又は2であり、 R^4 がC1-C3アルキル基で示されるチアジアゾール化合物；

式(I)において、 R^1 が(C3-C7)2-アルキニル基であり、Aが A^3 であり、nが0で示されるチアジアゾール化合物；

式 (I) において、 R^1 が (C3-C7) 2-アルキニル基であり、A が A^3 であり、 R^4 がメチル基で示されるチアジアゾール化合物；

式 (I) において、 R^1 が (C3-C7) 2-アルキニル基であり、A が A^3 であり、n が 1 又は 2 であり、 R^4 が C1-C3 アルキル基で示されるチアジアゾール化合物。

【0012】

本発明中間体の態様としては、例えば以下の 1, 2, 4-チアジアゾール化合物が挙げられる。

式 (II) において、A が A^1 で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、A が A^3 で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、A が A^1 であり、1 が 0 で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、A が A^1 であり、1 が 1 又は 2 で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、A が A^1 であり、 R^2 が C1-C4 アルキル基であり、1 が 1 又は 2 で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、A が A^1 であり、 R^2 がメチル基であり、1 が 1 又は 2 で示されるチアジアゾール化合物；

【0013】

式 (II) において、A が A^1 であり、 X^1 がブタン-1, 4-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、A が A^1 であり、 X^1 がペンタン-1, 5-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、A が A^1 であり、 X^1 がヘキサン-1, 6-ジイル基で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、q が 1 で示されるチアジアゾール化合物；

式 (II) において、q が 2 で示されるチアジアゾール化合物。

【0014】

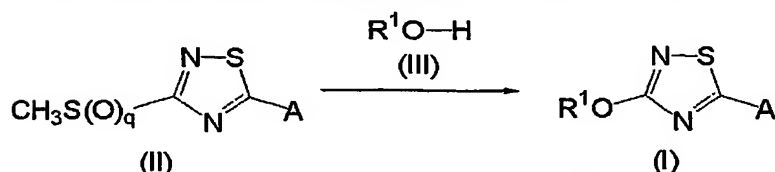
次に、本発明化合物の製造法について説明する。

本発明化合物は、例えば以下の（製造法）により製造することができる。

【0015】

製造法

式 (I) で示される本発明化合物は、式 (II) で示される本発明中間体と式 (III) で示される化合物とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。



〔式中、 R^1 、A 及び q は前記と同じ意味を表す。〕

該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、N, N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、カリウムtert-ブトキシド、ナトリウムtert-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式 (II) で示される本発明中間体 1 モルに対して、式 (III) で示される化合物が通常 1 ~ 2 モルの割合であり、塩基が通常 1 ~ 2 モルの割合である。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 80 °C の範囲であり、反応時間は通常 0.5 ~ 24 時間の範囲である。

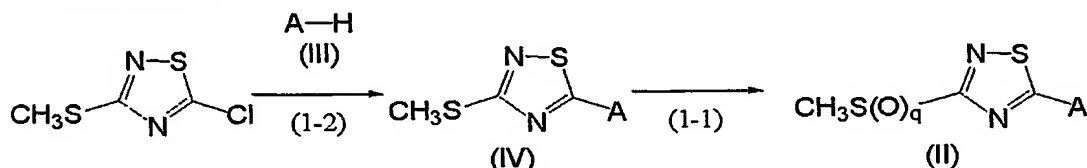
反応終了後は、反応混合物を有機溶媒抽出し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式 (I) で示される本発明化合物を単離することができる。単離された式 (I) で示される本発明化合物はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0016】

次に、本発明中間体の製造法について（中間体製造法）で説明する。

【0017】

中間体製造法



〔式中、A及びqは前記と同じ意味を表す。〕

（工程1）

式 (IV) で示される化合物は、3-メチルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾールと式 (III) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

該反応は溶媒の存在下又は非存在下、塩基の存在下又は非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、N,N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、メタノール、エタノール等のアルコール類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、カリウムtert-ブトキシド、ナトリウムtert-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、3-メチルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール1モルに対して、式 (III) で示される化合物が通常1～2モルの割合であり、塩基が通常1～2モルの割合である。

該反応の反応温度は、通常0～80℃の範囲であり、反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒抽出し、乾燥、濃縮する等の後処理操作により、式 (IV) で示される化合物を単離することができる。単離された式 (IV) で示される化合物は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

（工程2）

式 (II) で示される本発明中間体は、式 (IV) で示される化合物を酸化剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類及び水が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば3-クロロ過安息香酸、過酸化水素水等の過酸化物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式 (IV) で示される化合物1モルに対して、通常1モル～過剰量の割合である。

該反応の反応温度は、通常-20～30℃の範囲であり、反応時間は通常瞬時～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒抽出し、得られた有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式 (II) で示される本発明中間体を単離することができる。単離された式 (II) で示される本発明中間

体はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0018】

次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。

【0019】

式 (I) において、 R^1 が2-プロピニル基であり、Aが以下に示されるいずれかの基であるチアジアゾール化合物；

ピロリジノ基、2-メチルピロリジノ基、2-エチルピロリジノ基、2-n-プロピルピロリジノ基、2-イソプロピルピロリジノ基、2-tert-ブチルピロリジノ基、2-フルオロピロリジノ基、2-トリフルオロメチルピロリジノ基、3-メチルピロリジノ基、3-エチルピロリジノ基、3-トリフルオロメチルピロリジノ基、2, 5-ジメチルピロリジノ基、3, 4-ジメチルピロリジノ基、3, 3-ジメチルピロリジノ基、
ピペリジノ基、2-メチルピペリジノ基、2-エチルピペリジノ基、2-n-プロピルピペリジノ基、2-イソプロピルピペリジノ基、2-tert-ブチルピペリジノ基、2-sec-ブチルピペリジノ基、2-フルオロピペリジノ基、2-プロモピペリジノ基、2-トリフルオロメチルピペリジノ基、3-メチルピペリジノ基、3-エチルピペリジノ基、3-n-プロピルピペリジノ基、3-イソプロピルピペリジノ基、3-tert-ブチルピペリジノ基、3-sec-ブチルピペリジノ基、3-フルオロピペリジノ基、3-プロモピペリジノ基、3-トリフルオロメチルピペリジノ基、4-メチルピペリジノ基、4-エチルピペリジノ基、4-n-プロピルピペリジノ基、4-イソプロピルピペリジノ基、4-tert-ブチルピペリジノ基、4-トリフルオロメチルピペリジノ基、2, 6-ジメチルピペリジノ基、2, 4-ジメチルピペリジノ基、2, 5-ジメチルピペリジノ基、3, 5-ジメチルピペリジノ基、2, 2-ジメチルピペリジノ基、3, 3-ジメチルピペリジノ基、4, 4-ジメチルピペリジノ基、3-エチル-6-メチルピペリジノ基、3-エチル-5-メチルピペリジノ基、3, 5-ジエチルピペリジノ基、3, 5-ジ-n-プロピルピペリジノ基、3, 5-ジイソプロピルピペリジノ基、2, 3-ジメチルピペリジノ基、3, 3, 5-トリメチルピペリジノ基、2, 3, 5, 6-テトラメチルピペリジノ基、3, 3, 5, 5-テトラメチルピペリジノ基、3, 3-ジフルオロピペリジノ基、4, 4-ジフルオロピペリジノ基、3-フルオロ-3-メチルピペリジノ基、
ヘキサメレンイミノ基、2-メチルヘキサメレンイミノ基、2-エチルヘキサメレンイミノ基、2-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、2-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、2-tert-ブチルヘキサメレンイミノ基、3-メチルヘキサメレンイミノ基、3-エチルヘキサメレンイミノ基、3-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、3-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、4-メチルヘキサメレンイミノ基、4-エチルヘキサメレンイミノ基、4-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、4-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、5-メチルヘキサメレンイミノ基、
ヘプタメチレンイミノ基、
モルホリノ基、2-メチルモルホリノ基、2-エチルモルホリノ基、3-メチルモルホリノ基、3-エチルモルホリノ基、2, 6-ジメチルモルホリノ基及び2, 6-ジエチルモルホリノ基。

【0020】

式 (I) において、 R^1 が2-ブチニル基であり、Aが以下に示されるいずれかの基であるチアジアゾール化合物；

ピロリジノ基、2-メチルピロリジノ基、2-エチルピロリジノ基、2-n-プロピルピロリジノ基、2-イソプロピルピロリジノ基、2-tert-ブチルピロリジノ基、2-フルオロピロリジノ基、2-トリフルオロメチルピロリジノ基、3-メチルピロリジノ基、3-エチルピロリジノ基、3-トリフルオロメチルピロリジノ基、2, 5-ジメチルピロリジノ基、3, 4-ジメチルピロリジノ基、3, 3-ジメチルピロリジノ基、
ピペリジノ基、2-メチルピペリジノ基、2-エチルピペリジノ基、2-n-プロピルピペリジノ基、2-イソプロピルピペリジノ基、2-tert-ブチルピペリジノ基、2-sec-ブチルピペリジノ基、2-フルオロピペリジノ基、2-プロモピペリジノ基、2-トリフ

ルオロメチルピペリジノ基、3-メチルピペリジノ基、3-エチルピペリジノ基、3-n-
 ープロピルピペリジノ基、3-イソプロピルピペリジノ基、3-tert-ブチルピペリジノ
 基、3-sec-ブチルピペリジノ基、3-フルオロピペリジノ基、3-ブromoピペリジノ
 基、3-トリフルオロメチルピペリジノ基、4-メチルピペリジノ基、4-エチルピペリ
 ジノ基、4-n-プロピルピペリジノ基、4-イソプロピルピペリジノ基、4-tert-ブ
 チルピペリジノ基、4-トリフルオロメチルピペリジノ基、2, 6-ジメチルピペリジノ
 基、2, 4-ジメチルピペリジノ基、2, 5-ジメチルピペリジノ基、3, 5-ジメチル
 ピペリジノ基、2, 2, -ジメチルピペリジノ基、3, 3-ジメチルピペリジノ基、4,
 4-ジメチルピペリジノ基、3-エチル-6-メチルピペリジノ基、3-エチル-5-メ
 チルピペリジノ基、3, 5-ジエチルピペリジノ基、3, 5-ジ-n-プロピルピペリジ
 ノ基、3, 5-ジイソプロピルピペリジノ基、2, 3-ジメチルピペリジノ基、3, 3,
 5-トリメチルピペリジノ基、2, 3, 5, 6-テトラメチルピペリジノ基、3, 3, 5
 , 5-テトラメチルピペリジノ基、3, 3-ジフルオロピペリジノ基、4, 4-ジフルオ
 ロピペリジノ基、3-フルオロ-3-メチルピペリジノ基、
 ヘキサメレンイミノ基、2-メチルヘキサメレンイミノ基、2-エチルヘキサメレンイミ
 ノ基、2-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、2-イソプロピルヘキサメレンイミノ基
 、2-tert-ブチルヘキサメレンイミノ基、3-メチルヘキサメレンイミノ基、3-エチ
 ルヘキサメレンイミノ基、3-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、3-イソプロピルヘ
 キサメレンイミノ基、4-メチルヘキサメレンイミノ基、4-エチルヘキサメレンイミノ
 基、4-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、4-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、
 5-メチルヘキサメレンイミノ基、
 ヘプタメチレンイミノ基、
 モルホリノ基、2-メチルモルホリノ基、2-エチルモルホリノ基、3-メチルモルホリ
 ノ基、3-エチルモルホリノ基、2, 6-ジメチルモルホリノ基及び2, 6-ジエチルモ
 ルホリノ基。

【0021】

式 (I) において、 R^1 が1-メチル-2-ブチニル基であり、Aが以下に示されるいずれ
 かの基であるチアジアゾール化合物；

ピロリジノ基、2-メチルピロリジノ基、2-エチルピロリジノ基、2-n-プロピルピ
 ロリジノ基、2-イソプロピルピロリジノ基、2-tert-ブチルピロリジノ基、2-フル
 オロピロリジノ基、2-トリフルオロメチルピロリジノ基、3-メチルピロリジノ基、3
 -エチルピロリジノ基、3-トリフルオロメチルピロリジノ基、2, 5-ジメチルピロリ
 ジノ基、3, 4-ジメチルピロリジノ基、3, 3-ジメチルピロリジノ基、
 ピペリジノ基、2-メチルピペリジノ基、2-エチルピペリジノ基、2-n-プロピルピ
 ペリジノ基、2-イソプロピルピペリジノ基、2-tert-ブチルピペリジノ基、2-sec-
 ブチルピペリジノ基、2-フルオロピペリジノ基、2-ブromoピペリジノ基、2-トリフ
 ルオロメチルピペリジノ基、3-メチルピペリジノ基、3-エチルピペリジノ基、3-n-
 ープロピルピペリジノ基、3-イソプロピルピペリジノ基、3-tert-ブチルピペリジノ
 基、3-sec-ブチルピペリジノ基、3-フルオロピペリジノ基、3-ブromoピペリジノ
 基、3-トリフルオロメチルピペリジノ基、4-メチルピペリジノ基、4-エチルピペリ
 ジノ基、4-n-プロピルピペリジノ基、4-イソプロピルピペリジノ基、4-tert-ブ
 チルピペリジノ基、4-トリフルオロメチルピペリジノ基、2, 6-ジメチルピペリジノ
 基、2, 4-ジメチルピペリジノ基、2, 5-ジメチルピペリジノ基、3, 5-ジメチル
 ピペリジノ基、2, 2, -ジメチルピペリジノ基、3, 3-ジメチルピペリジノ基、4,
 4-ジメチルピペリジノ基、3-エチル-6-メチルピペリジノ基、3-エチル-5-メ
 チルピペリジノ基、3, 5-ジエチルピペリジノ基、3, 5-ジ-n-プロピルピペリジ
 ノ基、3, 5-ジイソプロピルピペリジノ基、2, 3-ジメチルピペリジノ基、3, 3,
 5-トリメチルピペリジノ基、2, 3, 5, 6-テトラメチルピペリジノ基、3, 3, 5
 , 5-テトラメチルピペリジノ基、3, 3-ジフルオロピペリジノ基、4, 4-ジフルオ
 ロピペリジノ基、3-フルオロ-3-メチルピペリジノ基、

ヘキサメレンイミノ基、2-メチルヘキサメレンイミノ基、2-エチルヘキサメレンイミノ基、2-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、2-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、2-tert-ブチルヘキサメレンイミノ基、3-メチルヘキサメレンイミノ基、3-エチルヘキサメレンイミノ基、3-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、3-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、4-メチルヘキサメレンイミノ基、4-エチルヘキサメレンイミノ基、4-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、4-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、5-メチルヘキサメレンイミノ基、ヘプタメチレンイミノ基、モルホリノ基、2-メチルモルホリノ基、2-エチルモルホリノ基、3-メチルモルホリノ基、3-エチルモルホリノ基、2, 6-ジメチルモルホリノ基及び2, 6-ジエチルモルホリノ基。

【0022】

式(I)において、 R^1 が2-ペンチニル基であり、Aが以下に示されるいずれかの基であるチアジアゾール化合物；

ピロリジノ基、2-メチルピロリジノ基、2-エチルピロリジノ基、2-n-プロピルピロリジノ基、2-イソプロピルピロリジノ基、2-tert-ブチルピロリジノ基、2-フルオロピロリジノ基、2-トリフルオロメチルピロリジノ基、3-メチルピロリジノ基、3-エチルピロリジノ基、3-トリフルオロメチルピロリジノ基、2, 5-ジメチルピロリジノ基、3, 4-ジメチルピロリジノ基、3, 3-ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2-メチルピペリジノ基、2-エチルピペリジノ基、2-n-プロピルピペリジノ基、2-イソプロピルピペリジノ基、2-tert-ブチルピペリジノ基、2-sec-ブチルピペリジノ基、2-フルオロピペリジノ基、2-ブromoピペリジノ基、2-トリフルオロメチルピペリジノ基、3-メチルピペリジノ基、3-エチルピペリジノ基、3-n-プロピルピペリジノ基、3-イソプロピルピペリジノ基、3-tert-ブチルピペリジノ基、3-sec-ブチルピペリジノ基、3-フルオロピペリジノ基、3-ブromoピペリジノ基、3-トリフルオロメチルピペリジノ基、4-メチルピペリジノ基、4-エチルピペリジノ基、4-n-プロピルピペリジノ基、4-イソプロピルピペリジノ基、4-tert-ブチルピペリジノ基、4-トリフルオロメチルピペリジノ基、2, 6-ジメチルピペリジノ基、2, 4-ジメチルピペリジノ基、2, 5-ジメチルピペリジノ基、3, 5-ジメチルピペリジノ基、2, 2-ジメチルピペリジノ基、3, 3-ジメチルピペリジノ基、4, 4-ジメチルピペリジノ基、3-エチル-6-メチルピペリジノ基、3-エチル-5-メチルピペリジノ基、3, 5-ジエチルピペリジノ基、3, 5-ジ-n-プロピルピペリジノ基、3, 5-ジイソプロピルピペリジノ基、2, 3-ジメチルピペリジノ基、3, 3, 5-トリメチルピペリジノ基、2, 3, 5, 6-テトラメチルピペリジノ基、3, 3, 5, 5-テトラメチルピペリジノ基、3, 3-ジフルオロピペリジノ基、4, 4-ジフルオロピペリジノ基、3-フルオロ-3-メチルピペリジノ基、ヘキサメレンイミノ基、2-メチルヘキサメレンイミノ基、2-エチルヘキサメレンイミノ基、2-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、2-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、2-tert-ブチルヘキサメレンイミノ基、3-メチルヘキサメレンイミノ基、3-エチルヘキサメレンイミノ基、3-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、3-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、4-メチルヘキサメレンイミノ基、4-エチルヘキサメレンイミノ基、4-n-プロピルヘキサメレンイミノ基、4-イソプロピルヘキサメレンイミノ基、5-メチルヘキサメレンイミノ基、ヘプタメチレンイミノ基、モルホリノ基、2-メチルモルホリノ基、2-エチルモルホリノ基、3-メチルモルホリノ基、3-エチルモルホリノ基、2, 6-ジメチルモルホリノ基及び2, 6-ジエチルモルホリノ基。

【0023】

本発明化合物が効力を有する有害生物としては、例えば昆虫やダニ等の節足動物および線虫等の線形動物があげられ、具体的には例えば以下に示すものがあげられる。

【0024】

半翅目害虫：ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)等のウンカ類、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)等のアブラムシ類、カメムシ類、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)等のコナジラミ類、カイガラムシ類、グンバイムシ類、キジラミ類等；

【0025】

鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ヨーロッパコンボレー (*Ostrinia nubilalis*)、シバツトガ (*Parapediasia teterrella*)等のメイガ類、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、トリコプルシア属 (*Trichoplusia* spp.)、ヘリオティス属 (*Heliothis* spp.)、ヘリコベルパ属 (*Helicoverpa* spp.)、エアリアス属 (*Earias* spp.)等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)等のシロチョウ類、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、コドリゲモス (*Cydia pomonella*)等のハマキガ類、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)等のシンクイガ類、モモハモグリガ (*Lyonetia clerkella*)等のチビガ類、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)等のホソガ類、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)等のコハモグリガ類、コナガ (*Plutella xylostella*)等のスガ類、ピンクボールワーム (*Pectinophora gossypiella*)等のキバガ類、ヒトリガ類、ヒロズコガ類等；

【0026】

双翅目害虫：アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)等のイエカ類、(Aedes aegypti)、(Aedes albopictus)等のエーデス属、(Anopheles sinensis)等のアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ (*Musca domestica*)、オオイエバエ (*Muscina stabulans*)等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)等のハナバエ類、ミバエ類、ショウジョウバエ類、チョウバエ類、ブユ類、アブ類、サシバエ類、ハモグリバエ類等；

【0027】

鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)等のコガネムシ類、メイズウィービル (*Sitophilus zeamais*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptus oryzophilus*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chienensis*)等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)等のゴミムシダマシ類、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)等のハムシ類、シバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ類、ナガシクイムシ類、カミキリムシ類、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*)等；

【0028】

アザミウマ目害虫：ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)等のスリップス属、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)等のフランクリニエラ属、チャノキイロアザミウマ (*Sciltothrips dorsalis*)等のシルトスリップス属等のアザミウマ類、クダアザミウマ類等；

【0029】

膜翅目害虫：ハバチ類、アリ類、スズメバチ類等；

網翅目害虫:ゴキブリ類、チャバネゴキブリ類等;

直翅目害虫:バッタ類、ケラ類等;

隠翅目害虫:ヒトノミ等;

シラミ目害虫:ヒトジラミ等;

シロアリ目害虫:シロアリ類等;

【0030】

ダニ目害虫:ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、オリゴニカス属等のハダニ類、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*) 等のフシダニ類、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) 等のホコリダニ類、ヒメハダニ類、ケナガハダニ類、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanicus*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*) 等のマダニ類、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*) 等のコナダニ類、コナヒョウヒダニ (*Dermatophagoides farinae*)、ヤケヒョウヒダニ (*Dermatophagoides pteromyssus*) 等のヒョウヒダニ類、ホソツメダニ (*Cheyletus eruditus*)、クワガタツメダニ (*Cheyletus malaccensis*)、ミナミツメダニ (*Cheyletus moorei*) 等のツメダニ類、ワクモ類等;

【0031】

線虫類:ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus fallax*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 等。

【0032】

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物そのものであってもよいが、通常は、本発明化合物と固体担体、液体担体、ガス状担体及び/又は餌とを混合し、必要により界面活性剤その他の製剤用補助剤を添加して、油剤、乳剤、フロアブル剤、粒剤、粉剤、毒餌、マイクロカプセル剤等に製剤化されている。

これらの製剤は、本発明化合物を通常 0.01~95 重量%含有する。

【0033】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類 (カオリンクレー、珪藻土、合成含水酸化珪素、ペントナイト、フバサミクレー、酸性白土等)、タルク類、セラミック、その他の無機鉱物 (セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等)、化学肥料 (硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等) 等の微粉末あるいは粒状物が挙げられ、液体担体としては、例えば水、アルコール類 (メタノール、エタノール等)、ケトン類 (アセトン、メチルエチルケトン等)、芳香族炭化水素類 (ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等)、脂肪族炭化水素類 (ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等)、エステル類 (酢酸エチル、酢酸ブチル等)、ニトリル類 (アセトニトリル、イソブチロニトリル等)、エーテル類 (ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等)、酸アミド類 (N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等)、ハロゲン化炭化水素類 (ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等)、ジメチルスルホキシド、及び植物油 (大豆油、綿実油等) が挙げられる。

ガス状担体としては、例えばフルオロカーボン、ブタンガス、LPG (液化石油ガス)、ジメチルエーテル、及び炭酸ガスが挙げられる。

【0034】

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類、並びに糖アルコール誘導体が挙げられる。

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼ

イン、ゼラチン、多糖類（でんぷん粉、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ベントナイト、糖類、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）、PAP（酸性りん酸イソプロピル）、BHT（2, 6-ジターシャリーブチル-4-メチルフェノール）、BHA（2-ターシャリーブチル-4-メトキシフェノールと3-ターシャリーブチル-4-メトキシフェノールとの混合物）、植物油、鉱物油、及び脂肪酸又はそのエステルが挙げられる。

【0035】

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドロゲアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ粉末等の子どもやペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料、ピーナッツオイルなどの害虫誘引性香料等が挙げられる。

【0036】

本発明の有害生物防除方法は、通常本発明の有害生物防除剤を有害生物又は有害生物の生息場所に施用することにより行われる。

【0037】

本発明の有害生物防除剤を農林用として用いる場合、その施用量は通常 1000 m^2 あたり本発明化合物の量で $0.1 \sim 10000\text{ g}$ である。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤等に製剤化されたものである場合は、通常有効成分濃度が $10 \sim 10000\text{ ppm}$ となるように水で希釈して散布することにより施用し、本発明の有害生物防除剤が粒剤、粉剤等に製剤化されたものである場合には、通常そのまま施用する。

【0038】

本発明の有害生物防除剤は有害生物から保護すべき作物等の植物に対して茎葉処理することにより使用することができ、作物の苗を植え付ける前の苗床や植付けの時に植穴や株元に処理することにより使用することもできる。さらに、耕作地の土壤に生息する有害生物を防除する目的で該土壤に処理することにより使用してもよい。また、シート状やひも状等に加工した樹脂製剤を作物に巻き付ける、作物の近傍に張り渡す及び／又は株元の土壤表面に敷く等の方法で使用することもできる。

【0039】

また、本発明の有害生物防除剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壤改良剤、動物用飼料等と混用または併用することもできる。

かかる殺虫剤及び／又は殺ダニ剤及び／又は殺線虫剤としては、例えばフェニトロチオン、フェンチオン、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、アセフェート、メチダチオン、ジスルホトン、DDVP、スルプロホス、プロフェノホス、シアノホス、ジオキサベンゾホス、ジメトエート、フェントエート、マラチオン、トリクロロボン、アジンホスメチル、モノクロトホス、ジクロトホス、エチオン、ホスチアゼート等の有機リン系化合物、BPMC、ベンフラカルブ、プロポキスル、カルボスルファン、カルバリル、メソミル、エチオフエンカルブ、アルジカルブ、オキサミル、フェノチオカルブ、チオジカルブ、アラニカルブ等のカーバメート系化合物；

【0040】

エトフェンプロックス、フェンバレレート、エスフェンバレレート、フェンプロパトリン、シペルメトリン、 α -シペルメトリン、 Z -シペルメトリン、ペルメトリン、シハロトリン、 λ -シハロトリン、シフルトリン、 β -シフルトリン、デルタメトリン、シクロプロスリン、 ϵ -フルバリネート、フルシトリネート、ピフェンスリン、アクリナスリン、トラロメスリン、シラフルオフエン、ハルフェンプロックス等のピレスロイド化合物；

【0041】

チアメトキサム、ジノテフラン、アセタミプリド、クロチアニジン等のネオニコチノイド化合物、クロルフルアズロン、テフルベンズロン、フルフェノクスロン、ルフェニユロン等のベンゾイルフェニルウレア系化合物、テブフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフ

エノジド、クロマフェノジド等のベンゾイルヒドラジド化合物、ブプロフェジン等のチアジジン誘導体、カルタップ、チオシクロム、ベンスルタップ等のネライストキシン誘導体、エンドスルファン、γ-BHC、1, 1-ビス(クロロフェニル)-2, 2, 2-トリクロロエタノール等の塩素化炭化水素化合物、アミトラズ、クロルジメホルム等のホルムアミジン誘導体、ジアフェンチウロン等のチオ尿素誘導体、フェニルピラゾール系化合物、クロルフェナピル、ピメトロジン、スピノサッド、インドキサカルブ、ピリダリル、ピリプロキシフェン、フェノキシカルブ、ジオフェノラン、シロマジン、プロモプロピレート、テトラジホン、キノメチオネート、プロパルゲイト、フェンブタティンオキシド、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロフェンテジン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェナザキン、アセキノシル、ビフェナゼート、フルアクリピリム、ミルベメクチン、アヴェルメクチン、エマメクチン安息香酸塩、アザジラクチン[AZAD]、ポリナクチンコンプレックス[テトラナクチン、ジナクチン、トリナクチン]が挙げられる。

【実施例】

【0042】

以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。

なお、実施例中のシリカゲルクロマトグラフィーは、メルク社製シリカゲル60を用いて、ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒で展開させることのより確認した。

【0043】

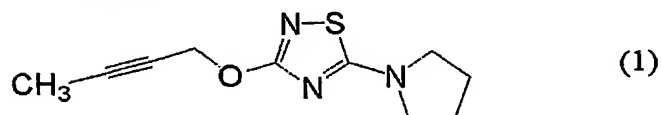
まず、本発明化合物の製造例を以下に示す。

【0044】

製造例 1

5-クロロ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 333 mg を N, N-ジメチルホルムアミド 4 ml に溶解し、ここに室温でピロリジン 142 mg を滴下し、6 時間撹拌した。反応混合物を tert-ブチルメチルエーテルで希釈し、10% 塩酸を加えて tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮し、得られた残渣にクロロホルム 4 ml を混合した。該混合液に氷冷下で 3-クロロ過安息香酸(含量; 65 重量%) 1.52 g を加え、室温で 6 時間撹拌した。反応混合物を 10%-亜硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮し、得られた残渣に N, N-ジメチルホルムアミド 4 ml 及び 2-ブチン-1-オール 140 mg を混合した。ここに氷冷下で水素化ナトリウム(油性、含量; 60 重量%) 120 mg を加えて 15 分間撹拌し、さらに室温で 6 時間撹拌した。反応混合物に飽和食塩水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-(2-ブチニルオキシ)-5-ピロリジノ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(1)と記す。) 158 mg を得た。

本発明化合物(1)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.90 (s, 2H), 3.42 (br, 4H), 2.06 (m, 4H), 1.85 (s, 3H)

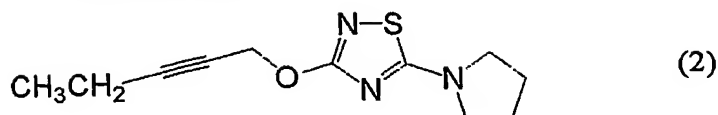
EI-Mass: $m/e = 223$ (M^+)

【0045】

製造例 2

2-ブチン-1-オールの代わりに 2-ペンチン-1-オール 168 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-ピロリジノ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(2)と記す。) 173 mg を得た。

本発明化合物 (2)



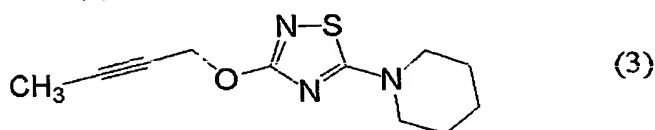
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.91 (s, 2H), 3.43 (br, 4H), 2.22 (m, 2H), 2.05 (m, 4H), 1.15 (t, 3H)
 EI-Mass: $m/e=237$ (M^+)

【0046】

製造例 3

ピロリジンの代わりにピペリジン 170 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-ピペリジノ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 (3) と記す。) 147 mg を得た。

本発明化合物 (3)



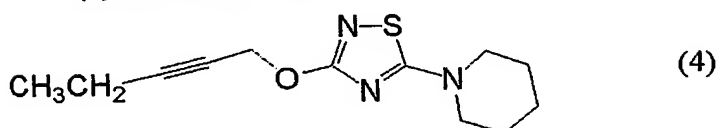
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (s, 2H), 3.43 (s, 4H), 1.85 (s, 3H), 1.67 (s, 6H)
 EI-Mass: $m/e=237$ (M^+)

【0047】

製造例 4

2-ブチン-1-オール の代わりに 2-ペンチン-1-オール 168 mg、ピロリジンの代わりにピペリジン 170 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-ピペリジノ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 (4) と記す。) 155 mg と記す。

本発明化合物 (4)



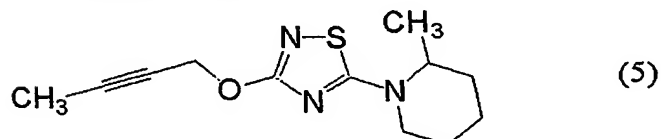
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.90 (s, 2H), 3.43 (s, 4H), 2.21 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.13 (t, 3H)
 EI-Mass: $m/e=251$ (M^+)

【0048】

製造例 5

ピロリジンの代わりに 2-メチルピペリジン 198 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-(2-メチルピペリジノ)-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 (5) と記す。) 133 mg を得た。

本発明化合物 (5)



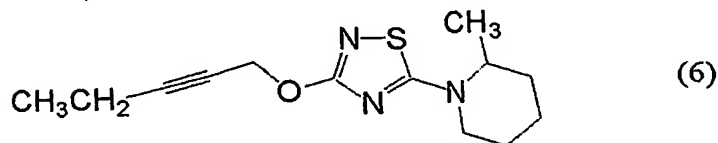
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (s, 2H) 4.11 (br, 1H) 3.63 (br, 1H) 3.21 (t, 1H) 1.86 (s, 3H) 1.85-1.47 (m, 6H) 1.26 (d, 3H)
 EI-Mass: $m/e=251$ (M^+)

【0049】

製造例 6

2-ブチン-1-オールの代わりに2-ペンチン-1-オール168mg、ピロリジンの代わりに2-メチルピペリジン198mgを用いた以外は製造例1と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-(2-メチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(6)と記す。)144mgを得た。

本発明化合物(6)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.91 (s, 2H), 4.12 (br, 1H), 3.61 (br, 1H), 3.20 (t, 1H), 2.24 (m, 2H), 1.82-1.47 (m, 4H), 1.26 (d, 3H), 1.13 (t, 3H)

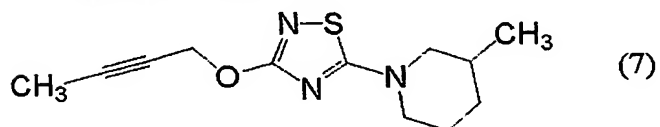
EI-Mass: $m/e = 265$ (M^+)

【0050】

製造例 7

ピロリジンの代わりに3-メチルピロリジン198mgを用いた以外は製造例1と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-(3-メチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(7)と記す。)141mgを得た。

本発明化合物(7)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (s, 2H), 3.72 (br, 2H), 3.06 (t, 1H), 2.72 (t, 1H), 1.86-1.55 (m, 7H), 1.15 (m, 1H), 0.94 (d, 3H)

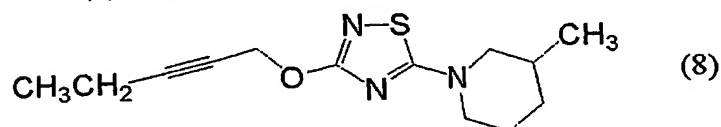
EI-Mass: $m/e = 251$ (M^+)

【0051】

製造例 8

2-ブチン-1-オール(2-ペンチン-1-オール)の代わりに2-ペンチン-1-オール168mgを用い、ピロリジンの代わりに3-メチルピペリジン198mgを用いた以外は製造例1と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-(3-メチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(8)と記す。)145mgを得た。

本発明化合物(8)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.91 (s, 2H), 3.73 (br, 2H), 3.05 (t, 1H), 2.72 (t, 1H), 2.22 (m, 2H), 1.89-1.54 (m, 4H), 1.21-1.06 (m, 4H), 0.94 (d, 3H)

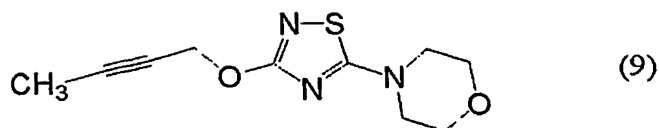
EI-Mass: $m/e = 265$ (M^+)

【0052】

製造例 9

ピロリジンの代わりにモルホリン174mgを用いた以外は製造例1と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-モルホリノ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(9)と記す。)82mgを得た。

本発明化合物(9)



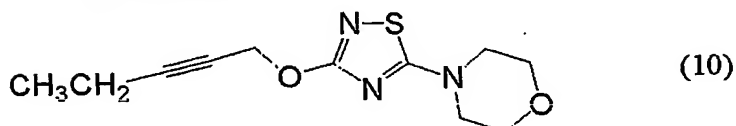
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (d, 2H), 3.78 (t, 4H), 3.47 (t, 4H), 1.85 (t, 3H)

【0053】

製造例10

2-ブチン-1-オールの代わりに2-ペンチン-1-オール168mgを用い、ピロリジンの代わりにモルホリン174mgを用いた以外は同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-モルホリノ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(10)と記す。)83mgを得た。

本発明化合物(10)



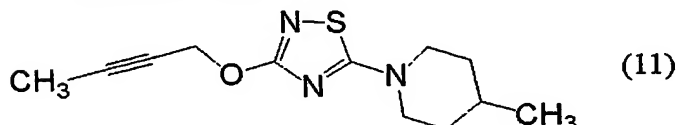
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.91 (d, 2H), 3.78 (t, 4H), 3.48 (t, 4H), 2.22 (m, 2H), 1.15 (t, 3H)

【0054】

製造例11

ピロリジンの代わりに4-メチルピペリジン198mgを用いた以外は製造例1と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-(4-メチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(11)と記す。)175mgを得た。

本発明化合物(11)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (s, 2H), 3.81 (br, 2H), 3.09 (t, 2H), 1.87 (s, 3H), 1.76-1.56 (m, 3H), 1.28 (m, 2H), 0.98 (d, 3H)

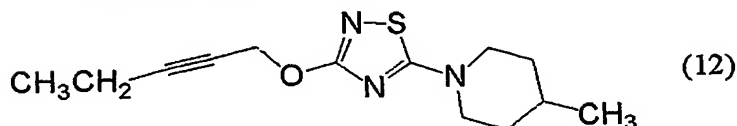
EI-Mass: $m/e=251$ (M^+)

【0055】

製造例12

2-ブチン-1-オール代わりに2-ペンチン-1-オール168mg、ピロリジンの代わりに4-メチルピペリジン198mgを用いた以外は製造例1と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-(4-メチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(12)と記す。)207mgを得た。

本発明化合物(12)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.90 (s, 2H), 3.80 (br, 2H), 3.08 (t, 2H), 2.24 (m, 2H), 1.78-1.58 (m, 3H), 1.26 (m, 2H), 1.13 (t, 3H), 0.98 (d, 3H)

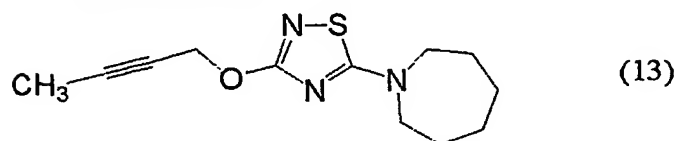
EI-Mass: $m/e=265$ (M^+)

【0056】

製造例13

ピロリジンの代わりにヘキサメチレンイミン 198 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-ヘキサメチレンイミノ-1,2,4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 (13)) と記す。151 mg を得た。

本発明化合物 (13)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (s, 2H), 3.71 (br, 2H), 3.28 (br, 2H), 1.86-1.74 (m, 7H), 1.61 (m, 4H)

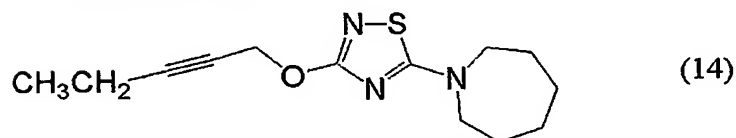
EI-Mass: $m/e = 251$ (M^+)

【0057】

製造例 14

2-ブチン-1-オールに代わって2-ペンチン-1-オール 168 mg、ピロリジンの代わりにヘキサメチレンイミン 198 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-ヘキサメチレンイミノ-1,2,4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 (14)) と記す。) 150 mg を得た。

本発明化合物 (14)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.90 (s, 2H), 3.92-3.08 (br, 4H), 2.23 (m, 2H), 1.83 (s, 4H), 1.62 (m, 4H), 1.15 (t, 3H)

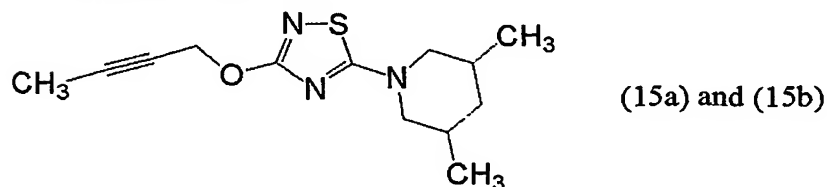
EI-Mass: $m/e = 265$ (M^+)

【0058】

製造例 15

ピロリジンの代わりに3,5-ジメチルピペリジン (8:2の異性体混合物) 226 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾールのシリカゲル薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン/酢酸エチル) において低極性成分の化合物 (以下、本発明化合物 (15a)) と記す。) 55 mg 及び高極性成分の化合物 (以下、本発明化合物 (15b)) と記す。) 22 mg を得た。

本発明化合物 (15a) 及び (15b)



本発明化合物 (15a)

融点 104.4°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (s, 2H), 3.74 (br, 2H), 2.57 (t, 2H), 1.92-1.70 (m, 6H), 0.92 (d, 6H), 0.81 (q, 1H)

EI-Mass: $m/e = 265$ (M^+)

本発明化合物 (15b)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.88 (s, 2H), 3.50 (

b r、2 H), 3.06 (b r、2 H), 2.03 (m、2 H), 1.86 (s、3 H), 1.48 (m、2 H), 0.95 (m、6 H)

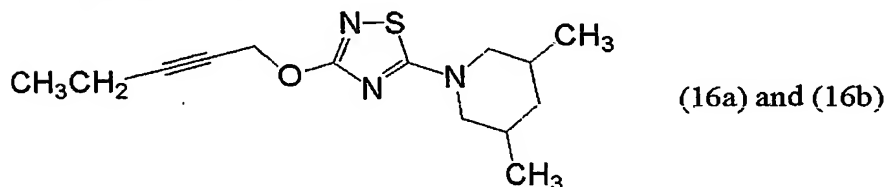
EI-Mass: m/e = 265 (M^+)

【0059】

製造例 16

2-ブチン-1-オールの代わりに2-ペンチン-1-オール 168 mg を用い、ピロリジンの代わりに3, 5-ジメチルピペリジン (8:2の異性体混合物) 226 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-(3, 5-ジメチルピペリジノ)-1, 2, 4-チアジアゾールのシリカゲル薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン/酢酸エチル) において低極性成分の化合物 (以下、本発明化合物 (16a) と記す。) 57 mg 及び高極性成分の化合物 (以下、本発明化合物 (16b) と記す。) 24 mg を得た。

本発明化合物 (16a) 及び (16b)



本発明化合物 (16a)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, TMS), δ (ppm): 4.90 (s、2H), 3.75 (b r、2H), 2.57 (t、2H), 2.23 (m、2H), 1.88-1.68 (m、3H), 1.13 (t、3H), 0.93 (d、6H), 0.80 (q、1H)

EI-Mass: m/e = 279 (M^+)

本発明化合物 (16b)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, TMS), δ (ppm): 4.90 (s、2H), 3.50 (b r、2H), 3.06 (b r、2H), 2.25 (m、2H), 2.03 (m、2H), 1.48 (t、2H), 1.14 (t、3H), 0.93 (d、6H)

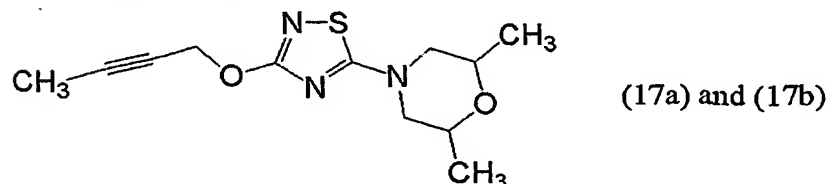
EI-Mass: m/e = 279 (M^+)

【0060】

製造例 17

ピロリジンの代わりに2, 6-ジメチルモルホリン (異性体混合物) 230 mg を用いた以外は製造例 1 と同様の操作を行い、3-(2-ブチニルオキシ)-5-(2, 6-ジメチルモルホリノ)-1, 2, 4-チアジアゾールのシリカゲル薄層クロマトグラフィー (展開溶媒; ヘキサン/酢酸エチル) において低極性成分の化合物 (以下、本発明化合物 (17a) と記す。) 160 mg 及び高極性成分の化合物 (以下、本発明化合物 (17b) と記す。) 76 mg を得た。

本発明化合物 (17a) 及び (17b)



本発明化合物 (17a)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, TMS), δ (ppm): 4.89 (s、2H), 3.75-3.46 (m、4H), 2.85 (dd、2H), 1.85 (s、3H), 1.21 (d、6H)

EI-Mass: m/e = 267 (M^+)

本発明化合物 (17b)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.89 (s, 2H), 4.08 (m, 2H), 3.54 (d, 2H), 3.16 (d, 2H), 1.86 (s, 3H), 1.24 (d, 6H)

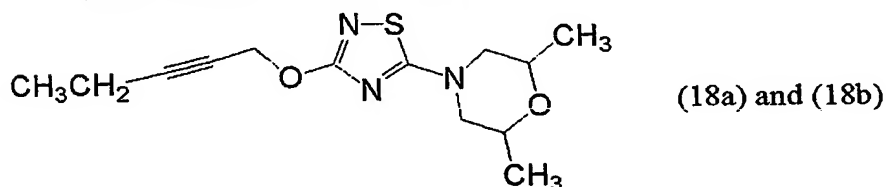
EI-Mass: $m/e = 267$ (M^+)

【0061】

製造例 18

2-ブチン-1-オールの代わりに2-ペンチン-1-オール168mg、ピロリジンの代わりに2,6-ジメチルモルホリン(異性体混合物)235mgを用いた以外は製造例1と同様の操作を行い、3-(2-ペンチニルオキシ)-5-(2,6-ジメチルモルホリノ)-1,2,4-チアジアゾールの低極性成分の化合物(以下、本発明化合物(18a)と記す。)172mg及び高極性成分の化合物(以下、本発明化合物(18b)と記す。)66mgを得た。

本発明化合物(18a)及び(18b)



本発明化合物(18a)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.91 (d, 2H), 3.77-3.44 (m, 4H), 2.85 (t, 2H), 2.21 (m, 2H), 1.23 (m, 6H), 1.12 (t, 3H)

EI-Mass: $m/e = 281$ (M^+)

本発明化合物(18b)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.91 (t, 2H), 4.12 (m, 2H), 3.56 (m, 2H), 3.17 (m, 2H), 2.24 (m, 2H), 1.25 (d, 6H), 1.14 (t, 3H)

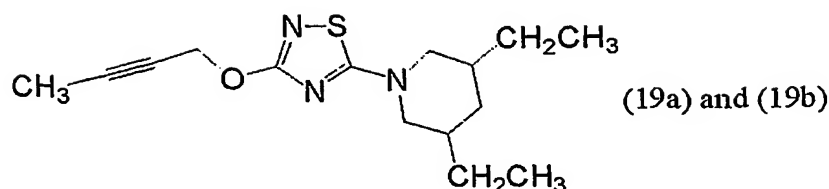
EI-Mass: $m/e = 281$ (M^+)

【0062】

製造例 19

N,N-ジメチルホルムアミド6mlに、参考製造例1により得られたジエチルピペリジンの粗生成物1.2g、5-クロロ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール500mg及び炭酸カリウム495mgを混合して、室温で3時間攪拌した。反応混合物をtert-ブチルメチルエーテルで希釈し、10%塩酸を加えてtert-ブチルメチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をクロロホルム6mlと混合し、該混合液に氷冷下で3-クロロ過安息香酸(含量; 65重量%)1.76gを加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物を10%-亜硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣にN,N-ジメチルホルムアミド2ml及び2-ブチン-1-オール78mgを混合し、ここに氷冷下で水素化ナトリウム(油性、含量; 60重量%)55mgを加えて15分間攪拌し、さらに室温で2時間攪拌した。反応混合物に飽和食塩水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(2-ブチニルオキシ)-5-(3,5-ジエチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾールの低極性成分の化合物(以下、本発明化合物(19a)と記す。)106mg及び高極性成分の化合物(以下、本発明化合物(19b)と記す。)27mgを得た。

本発明化合物(19a)及び(19b)



本発明化合物 (19a)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.80 (s, 2H), 3.81 (br, 2H), 2.61 (t, 2H), 1.98 (d, 1H), 1.87 (s, 3H), 1.58–1.44 (m, 2H), 1.36–1.21 (m, 4H), 0.94 (t, 6H), 0.72 (q, 1H)

融点 47.7°C

本発明化合物 (19b)

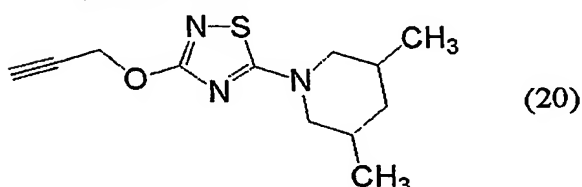
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.88 (s, 2H), 3.52 (br, 2H), 3.13 (br, 2H), 1.87 (s, 3H), 1.76–1.66 (m, 2H), 1.57–1.52 (m, 2H), 1.42–1.22 (m, 4H), 0.93 (t, 6H)

【0063】

製造例20

3-メチルスルホニル-5-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール373mg及び2-プロピン-1-オール84mgをN,N-ジメチルホルムアミド3mlに溶解し、氷冷下で水素化ナトリウム(油性、含量;60重量%)71mgを加え、15分間攪拌し、さらに室温で1.5時間攪拌した。反応混合物を水に加え、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(2-プロピニルオキシ)-5-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(20)と記す。)326mgを得た。

本発明化合物(20)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 4.93 (s, 2H), 3.74 (br, 1.6H), 3.51 (br, 0.4H), 3.06 (br, 0.4H), 2.60 (t, 1.6H), 2.49 (s, 1H), 2.05 (m, 0.4H), 1.83 (m, 0.8H), 1.75 (m, 1.6H), 1.50 (t, 0.4H), 0.98 (d, 1.8H), 0.95 (d, 4H), 0.87 (q, 0.8H)

【0064】

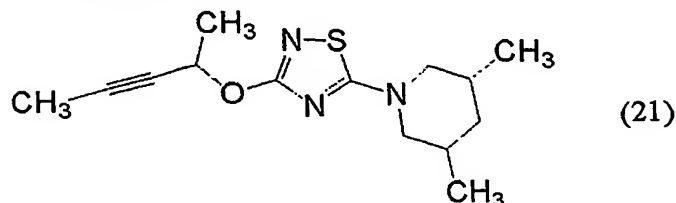
製造例21

N,N-ジメチルホルムアミド3mlに3-メチルスルフィニル-5-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール287mg及び3-ペンチン-2-オール103mgを溶解し、氷冷下でここに水素化ナトリウム(油状、含量;60%)58mgを加え、15分間攪拌した後、さらに室温で1.5時間攪拌した。該混合液に水素化ナトリウム(油状、含量;60%)30mg

及び3-ペンチン-2-オール100mgを加え、室温で30分間攪拌した。反応混合液をtert-ブチルメチルエーテルで希釈してから水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-(3-ペンチニル-2-オキシ)-

5-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物(21)と記す。)297mgを得た。

本発明化合物(21)



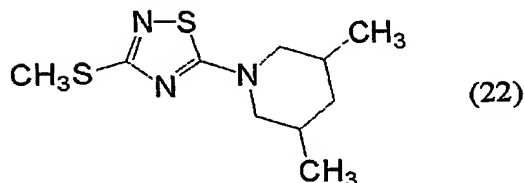
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 5.47 (m, 1H), 3.76 (br, 1.6H), 3.52 (br, 0.4H), 3.05 (br, 0.4H), 2.57 (t, 1.6H), 2.02 (m, 0.4H), 1.87-1.67 (m, 2.4H), 1.84 (s, 3H), 1.59 (d, 3H), 1.49 (t, 0.4H), 0.96 (d, 1.2H), 0.92 (d, 4.8H), 0.81 (q, 0.8H)

【0065】

製造例 22

5-クロロ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール740mgをN,N-ジメチルホルムアミド9mlに溶解し、ここに氷冷下、3,5-ジメチルピペリジン(8:2の異性体混合物)1.25gを滴下し、室温で20分間攪拌した。反応混合物をtert-ブチルメチルエーテルで希釈し、10%塩酸を加えてtert-ブチルメチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-メチルチオ-5-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、化合物(22)と記す。)860mgを得た。

化合物(22)



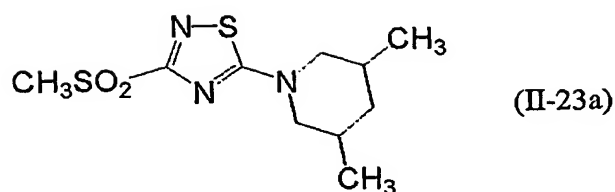
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 3.76 (br, 1.6H), 1.57 (br, 0.4H), 3.06 (m, 0.4H), 2.62 (t, 1.6H), 2.59 (s, 3H), 2.04 (m, 0.4H), 1.88-1.68 (m, 2.4H), 1.49 (t, 0.4H), 0.98 (d, 1.2H), 0.93 (d, 4.8H), 0.81 (q, 0.8H)

【0066】

製造例 23

前記製造例22より得られた化合物(22)をクロロホルム10mlと混合し、氷冷下で3-クロロ過安息香酸(含量;65重量%)1.41gを加え、室温で2時間攪拌した。その後、16時間放置し、反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えクロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-メチルスルホニル-3-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明中間体(II-23a)と記す。)373mg及び3-メチルスルフィニル-3-(3,5-ジメチルピペリジノ)-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明中間体(II-23b)と記す。)287mgを得た。

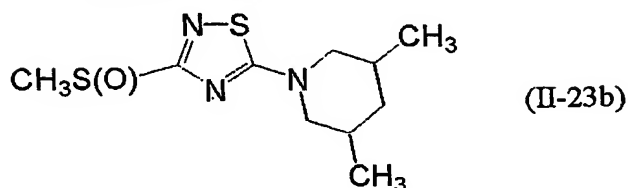
本発明中間体(II-23a)



白色固体

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 3.68 (br), 3.23 (s, 3H), 3.10 (br), 2.70 (br), 2.08 (m), 1.92–1.64 (m), 1.49–1.43 (m), 1.01–1.70 (m)

本発明中間体 (II-23b)



油状物質

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS)、 δ (ppm): 3.76 (br), 3.14 (br), 2.96 (s, 3H), 2.68 (m), 2.08 (m), 1.92–1.70 (m), 1.53 (t), 1.01–0.95 (m), 0.85 (q)

【0067】

次に、本発明化合物の製剤例について示す。部とは重量部を示す。

製剤例 1

本発明化合物 9 部を、キシレン 37.5 部およびジメチルホルムアミド 37.5 部に溶解し、これにポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 10 部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、よく攪拌混合して乳剤を得る。

【0068】

製剤例 2

本発明化合物 9 部を、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪素土 65 部を混合した中に加え、よく攪拌混合して水和剤を得る。

【0069】

製剤例 3

本発明化合物 3 部、合成含水酸化珪素微粉末 5 部、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム 5 部、ペントナイト 30 部およびクレー 57 部を加え、よく攪拌混合し、ついでこれらの混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、増粒機で製粒し、通風乾燥して粒剤を得る。

【0070】

製剤例 4

本発明化合物 4.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、凝集剤としてドリレス B (三共社製) 1 部、クレー 7 部を乳鉢でよく混合した後にジュースミキサーで攪拌混合する。得られた混合物にカットクレー 86.5 部を加えて、充分攪拌混合し、粉剤を得る。

【0071】

製剤例 5

本発明化合物 10 部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩 50 部を含むホワイトカーボン 35 部及び水 55 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、製剤を得る。

【0072】

次に、本発明化合物が有害生物に防除効力を有することを試験例で示す。

【0073】

試験例 1

製剤例 5 により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

一方、ポリエチレンカップにキュウリを植え、第 1 本葉が展開するまで生育させ、そこにワタアブラムシ約 20 頭を寄生させた。1 日後、そのキュウリに上記の試験用散布液を 20 ml / カップの割合で散布した。散布 6 日後にワタアブラムシの数を調査し、次の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{a i}) / (C_{a i} \times T_b)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の処理前の虫数

$C_{a i}$: 無処理区の観察時の虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

$T_{a i}$: 処理区の観察時の虫数

その結果、本発明化合物 (3) ~ (11)、(14)、(15a)、(15b)、(16a)、(17a)、(17b)、(18a)、(18b)、(19)、(20) 及び (21) は各々防除価 90% 以上を示した。

【0074】

試験例 2

製剤例 5 により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

一方、ポリエチレンカップにキャベツを植えて第一本葉が展開するまで生育させ、第一本葉を残して他の葉は切除し、これにシルバーリーフコナジラミ成虫を放して約 24 時間産卵させた。こうして 80 ~ 100 卵程度産卵されたキャベツを 8 日間温室内に保持し、産卵された卵から幼虫が孵化してきた状態のところに上記の試験用散布液を 20 ml / カップの割合で散布した。散布 7 日後に生存幼虫数を数えた。

その結果、本発明化合物 (4) ~ (8)、(11) ~ (14)、(15a)、(15b)、(16a)、(16b)、(17a)、(18a)、(19)、(20) 及び (21) を処理したキャベツ葉における生存幼虫数は 10 頭以下であった。

【0075】

試験例 3

製剤例 5 により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が 500 ppm となるように希釈し、試験用散布液を調製した。

一方、ポリエチレンカップに培土ボンソル 2 号 (住友化学工業 (株) 製) 50 g を入れて種子を 10 ~ 15 粒播種し、第 2 本葉が展開するまで生育させた後、高さを 5 cm に切り揃えたイネに対し、上記の試験用散布液を 20 ml / カップの割合で散布した。イネに散布処理された薬液が乾燥した後、トビイロウンカの初齢幼虫を 30 頭放し、温室内 (25℃) に静置した。トビイロウンカの幼虫を放してから 6 日後に当該イネに寄生するトビイロウンカの数調査した。

その結果、本発明化合物 (4) ~ (8)、(12)、(17a) 及び (18a) の処理においては各々処理 6 日後に寄生するトビイロウンカ数は 3 頭以下であった。

【書類名】 要約書

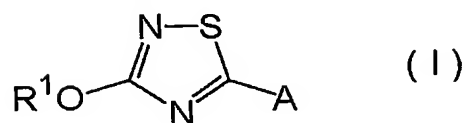
【要約】

【課題】

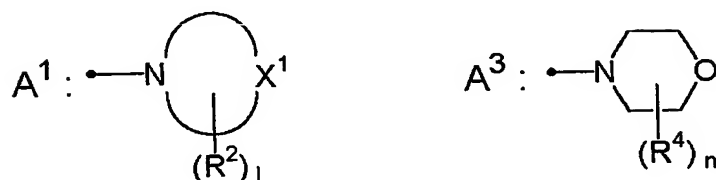
有害生物に対する防除効力を有する化合物を提供すること。

【解決手段】

式 (I)



〔式中、 R^1 はC3-C7アルキニル基を表し、
Aは下記の A^1 又は A^3 を表し、



X^1 はC4-C7アルカンジイル基又はC4-C7アルケンジイル基を表し、 R^2 はハロゲン原子、トリフルオロメチル基又はC1-C4アルキル基を表し、 R^4 はC1-C3アルキル基を表し、1は0-4までの整数を表し、nは0-2の整数を表す。1が2以上の整数である場合、 R^2 は同一又は相異なる基を表し、nが2である場合、 R^4 は同一又は相異なる基を表す。〕で示される1, 2, 4-チアジアゾール化合物は有害生物に対して優れた防除効力を有する。

【選択図】 なし

特願 2 0 0 3 - 3 5 4 7 5 8

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[0 0 0 0 0 2 0 9 3]

1. 変更年月日

1 9 9 0 年 8 月 2 8 日

[変更理由]

新規登録

住 所

大阪府大阪市中央区北浜 4 丁目 5 番 3 3 号

氏 名

住友化学工業株式会社

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.